

21.12.2004

日本国特許庁  
JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

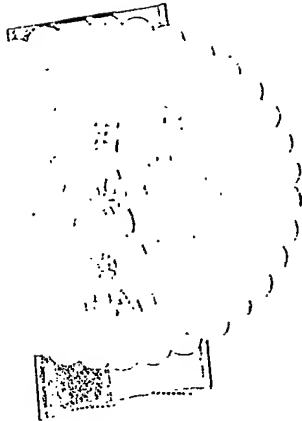
This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日  
Date of Application: 2003年12月22日

出願番号  
Application Number: 特願2003-424579  
[ST. 10/C]: [JP 2003-424579]

REC'D 13 JAN 2005	
WIPO	PCT

出願人  
Applicant(s): 住友化学株式会社

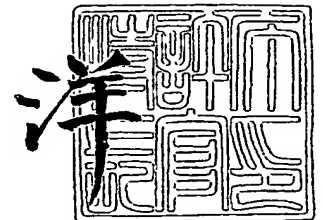


PRIORITY DOCUMENT  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH  
RULE 17.1(a) OR (b)

2004年11月10日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

小川



BEST AVAILABLE COPY

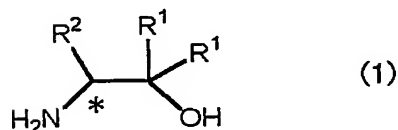
【書類名】 特許願  
【整理番号】 P156562  
【提出日】 平成15年12月22日  
【あて先】 特許庁長官殿  
【国際特許分類】 C07C233/04  
【発明者】  
    【住所又は居所】 大阪市此花区春日出中 3 丁目 1 番 9 8 号 住友化学工業株式会社  
                        内  
    【氏名】 板垣 誠  
【特許出願人】  
    【識別番号】 000002093  
    【氏名又は名称】 住友化学工業株式会社  
【代理人】  
    【識別番号】 100093285  
    【弁理士】  
    【氏名又は名称】 久保山 隆  
    【電話番号】 06-6220-3405  
【選任した代理人】  
    【識別番号】 100113000  
    【弁理士】  
    【氏名又は名称】 中山 亨  
    【電話番号】 06-6220-3405  
【選任した代理人】  
    【識別番号】 100119471  
    【弁理士】  
    【氏名又は名称】 榎本 雅之  
    【電話番号】 06-6220-3405  
【手数料の表示】  
    【予納台帳番号】 010238  
    【納付金額】 21,000円  
【提出物件の目録】  
    【物件名】 特許請求の範囲 1  
    【物件名】 明細書 1  
    【物件名】 要約書 1  
    【包括委任状番号】 0212949

## 【書類名】 特許請求の範囲

## 【請求項 1】

リチウム化合物の存在下、式 (1)

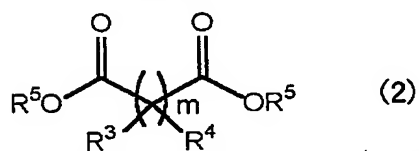
## 【化 1】



(式中、 $R^1$  は炭素数 1～6 のアルキル基、置換されていてもよいアラルキル基、置換されていてもよいフェニル基または水素原子を表わし、 $R^2$  は炭素数 1～6 のアルキル基、置換されていてもよいアラルキル基、置換されていてもよいフェニル基、1-ナフチル基または 2-ナフチル基を表わす。ここで、 $R^1$  が炭素数 1～6 のアルキル基を表わす場合は、同じ炭素原子に結合する二つの  $R^1$  が結合してその結合炭素原子とともに環を形成してもよい。\* は不斉中心を表わす。)

で示される光学活性なアミノアルコール化合物と、式 (2)

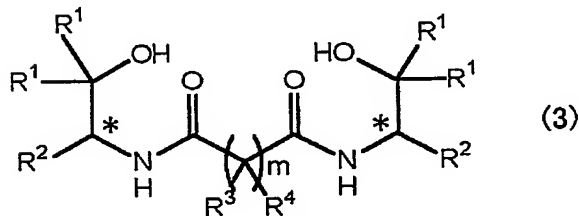
## 【化 2】



(式中、 $R^3$  および  $R^4$  は同一または相異なって、それぞれ水素原子または炭素数 1～3 のアルキル基を表わす。 $R^5$  は炭素数 1～3 のアルキル基を表す。 $m$  は 0～2 の整数を表す。)

で示されるジエステル化合物とを反応させることによる式 (3)

## 【化 3】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $m$  および \* は、上記と同一の意味を表わす。)

で示される光学活性なビスアミドアルコール化合物の製造方法。

## 【請求項 2】

リチウム化合物が、水酸化リチウム、リチウムアルコキシドおよびハロゲン化リチウムからなる群から選ばれる少なくとも一種のリチウム化合物である請求項 1 に記載の製造方法。

## 【請求項 3】

リチウムアルコキシドがリチウムメトキシドまたはリチウムエトキシドである請求項 2 に記載の製造方法。

## 【請求項 4】

ハロゲン化リチウムが塩化リチウムである請求項 2 に記載の製造方法。

## 【請求項 5】

副生する式 (4)

## 【化 4】



(式中、 $R^5$  は上記と同一の意味を表わす。)

で示されるアルコールを除去しながら反応を実施する請求項 1 に記載の製造方法。

## 【書類名】明細書

【発明の名称】光学活性なビスアミドアルコール化合物の製造方法

## 【技術分野】

【0001】

本発明は、光学活性なビスアミドアルコール化合物の製造方法に関する。

## 【背景技術】

【0002】

光学活性なビスアミドアルコール化合物は、例えば不斉合成触媒の配位子である光学活性なビスオキサゾリン化合物の中間体に用いられる（例えば、特許文献1および2参照。）など、大変重要な化合物である。かかる光学活性なビスアミドアルコール化合物の製造方法として、例えば光学活性なアミノアルコールとマロン酸ジメチルとを無溶媒で加熱混合する方法（例えば、非特許文献1参照。）、光学活性なアミノアルコールとマロン酸ジクロリド化合物とを塩基の存在下に反応させて合成する方法（例えば、非特許文献2参照。）などが知られている。しかしながら、前者の方法では生成物の収率が充分ではなく、かつ生成物が固体の場合は反応物が凝固して操作性に問題が生じるおそれがあった。また、後者の方法では酸クロリド化の工程を経るため、製造コストが高くなるといった問題があり、さらに工業的に有利な、光学活性なビスアミドアルコール化合物の製造方法の開発が望まれていた。

【0003】

【特許文献1】特開平11-171874号公報

【特許文献2】特開2000-80060号公報

【非特許文献1】*Helvetica Chimica Acta*, 74, 232 (1991)【非特許文献2】*J. Org. Chem.*, 63, 4541 (1998)

## 【発明の開示】

## 【発明が解決しようとする課題】

【0004】

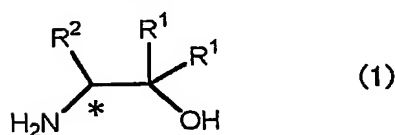
このような状況のもと、本発明者は、光学活性なビスアミドアルコール化合物のさらに効率のよい製造方法を開発すべく鋭意検討したところ、触媒量のリチウム化合物存在下、光学活性なアミノアルコール化合物とジエステル化合物とを反応させると、収率よく光学活性なビスアミドアルコール化合物が得られることを見だし、本発明に至った。

## 【課題を解決するための手段】

【0005】

すなわち本発明は、リチウム化合物の存在下、式(1)

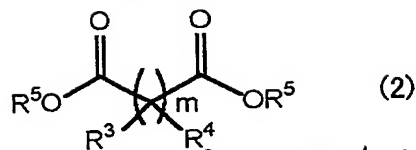
【化1】



(式中、 $\text{R}^1$  は炭素数1～6のアルキル基、置換されていてもよいアラルキル基、置換されていてもよいフェニル基または水素原子を表わし、 $\text{R}^2$  は炭素数1～6のアルキル基、置換されていてもよいアラルキル基、置換されていてもよいフェニル基、1-ナフチル基または2-ナフチル基を表わす。ここで、 $\text{R}^1$  が炭素数1～6のアルキル基を表わす場合は、同じ炭素原子に結合する二つの $\text{R}^1$  が結合してその結合炭素原子とともに環を形成してもよい。\*は不斉中心を表わす。)

で示される光学活性なアミノアルコール化合物と、式(2)

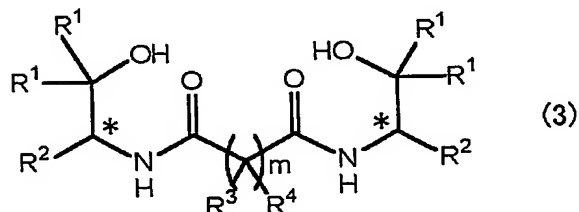
【化2】



(式中、 $R^3$  および  $R^4$  は同一または相異なって、それぞれ水素原子または炭素数 1～3 のアルキル基を表わす。 $R^5$  は炭素数 1～3 のアルキル基を表す。 $m$  は 0～2 の整数を表す。)

で示されるジエステル化合物とを反応させることによる式 (3)

【化3】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $m$  および  $*$  は、上記と同一の意味を表わす。)

で示される光学活性なビスアミドアルコール化合物の製造方法を提供するものである。

#### 【発明の効果】

##### 【0006】

本発明によれば、不斉合成触媒の配位子中間体等として有用な光学活性なビスアミドアルコール化合物を効率よく安価に製造することが可能となり、工業的に有利である。

#### 【発明を実施するための最良の形態】

##### 【0007】

以下、本発明を詳細に説明する。

##### 【0008】

式 (1) で示される光学活性なアミノアルコール化合物 (以下、光学活性なアミノアルコール (1) と略記する。) の式中、 $R^1$  は炭素数 1～6 のアルキル基、置換されていてもよいアラルキル基、置換されていてもよいフェニル基または水素原子を表わし、 $R^2$  は炭素数 1～6 のアルキル基、置換されていてもよいアラルキル基、置換されていてもよいフェニル基、1-ナフチル基または2-ナフチル基を表わす。また、 $R^1$  が炭素数 1～6 のアルキル基を表わす場合、同じ炭素原子に結合する二つの  $R^1$  が結合してその結合炭素原子とともに環を形成してもよい。 $*$  は不斉中心を表わす。

##### 【0009】

炭素数 1～6 のアルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基等の直鎖状または分枝鎖状のアルキル基が挙げられる。置換されていてもよいフェニル基としては、例えば無置換のフェニル基；例えば3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基等の前記炭素数 1～6 のアルキル基で置換されたフェニル基；例えば2-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基等の炭素数 1～6 のアルコキシ基；などで置換されたフェニル基等が挙げられる。置換されていてもよいアラルキル基としては、ナフチル基または上記置換されていてもよいフェニル基と前記炭素数 1～6 のアルキル基とから構成されるものであり、例えばベンジル基、4-メチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基等が挙げられる。

##### 【0010】

また、 $R^1$  が炭素数 1～6 のアルキル基を表わす場合であって、同じ炭素原子に結合する二つの  $R^1$  が結合してその結合炭素原子とともに環を形成していてもよく、かかる環としては、例えばシクロプロパン環、シクロブタン環、シクロペンタン環、シクロヘキサン環等が挙げられる。

##### 【0011】

ここで光学活性なアミノアルコール(1)としては、例えば(R)-2-アミノプロパノール、(R)-2-アミノ-1,1-ジメチルプロパノール、(R)-2-アミノ-1,1-ジエチルプロパノール、(R)-2-アミノ-1,1-ジ(n-プロピル)プロパノール、(R)-2-アミノ-1,1-ジフェニルプロパノール、(R)-2-アミノ-1,1-ジ(4-メチルフェニル)プロパノール、(R)-2-アミノ-1,1-ジ(2-メトキシフェニル)プロパノール、(R)-2-アミノ-1,1-ジ(4-メトキシフェニル)プロパノール、(R)-2-アミノ-1,1-ジベンジルプロパノール、1-((R)-1-アミノエチル)シクロブタノール、1-((R)-1-アミノエチル)シクロペンタノール、1-((R)-1-アミノエチル)シクロヘキサノール、

#### 【0012】

(R)-2-アミノ-3-メチルブタノール、(R)-2-アミノ-3-メチル-1,1-ジメチルブタノール、(R)-2-アミノ-3-メチル-1,1-ジエチルブタノール、(R)-2-アミノ-3-メチル-1,1-ジ(n-プロピル)ブタノール、(R)-2-アミノ-3-メチル-1,1-ジフェニルブタノール、(R)-2-アミノ-3-メチル-1,1-ジ(4-メチルフェニル)ブタノール、(R)-2-アミノ-3-メチル-1,1-ジ(2-メトキシフェニル)ブタノール、(R)-2-アミノ-3-メチル-1,1-ジ(4-メトキシフェニル)ブタノール、(R)-2-アミノ-3-メチル-1,1-ジベンジルブタノール、1-((R)-1-アミノ-2-メチルプロピル)シクロブタノール、1-((R)-1-アミノ-2-メチルプロピル)シクロペンタノール、1-((R)-1-アミノ-2-メチルプロピル)シクロヘキサノール、

#### 【0013】

(R)-2-アミノ-4-メチルペンタノール、(R)-2-アミノ-4-メチル-1,1-ジメチルペンタノール、(R)-2-アミノ-4-メチル-1,1-ジエチルペンタノール、(R)-2-アミノ-4-メチル-1,1-ジ(n-プロピル)ペンタノール、(R)-2-アミノ-4-メチル-1,1-ジフェニルペンタノール、(R)-2-アミノ-4-メチル-1,1-ジ(4-メチルフェニル)ペンタノール、(R)-2-アミノ-4-メチル-1,1-ジ(2-メトキシフェニル)ペンタノール、(R)-2-アミノ-4-メチル-1,1-ジ(4-メトキシフェニル)ペンタノール、(R)-2-アミノ-4-メチル-1,1-ジベンジルペンタノール、1-((R)-1-アミノ-3-メチルブチル)シクロブタノール、1-((R)-1-アミノ-3-メチルブチル)シクロペンタノール、1-((R)-1-アミノ-3-メチルブチル)シクロヘキサノール、

#### 【0014】

(R)-2-アミノ-3,3-ジメチルブタノール、(R)-2-アミノ-3,3-ジメチル-1,1-ジメチルブタノール、(R)-2-アミノ-3,3-ジメチル-1,1-ジエチルブタノール、(R)-2-アミノ-3,3-ジメチル-1,1-ジ(n-プロピル)ブタノール、(R)-2-アミノ-3,3-ジメチル-1,1-ジフェニルブタノール、(R)-2-アミノ-3,3-ジメチル-1,1-ジ(4-メチルフェニル)ブタノール、(R)-2-アミノ-3,3-ジメチル-1,1-ジ(2-メトキシフェニル)ブタノール、(R)-2-アミノ-3,3-ジメチル-1,1-ジ(4-メトキシフェニル)ブタノール、(R)-2-アミノ-3,3-ジメチル-1,1-ジベンジルブタノール、1-((R)-1-アミノ-2,2-ジメチルプロピル)シクロブタノール、1-((R)-1-アミノ-2,2-ジメチルプロピル)シクロペンタノール、1-((R)-1-アミノ-2,2-ジメチルプロピル)シクロヘキサノール、

#### 【0015】

(R)-2-アミノ-2-フェニルエタノール、(R)-2-アミノ-2-フェニル-1,1-ジメチルエタノール、(R)-2-アミノ-2-フェニル-1,1-ジエチルエタノール、(R)-2-アミノ-2-フェニル-1,1-ジ(n-プロピル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-フェニル-1,1-ジフェニルエタノール、(R)-2-アミノ-2-フェニル-1,1-ジ(4-メチルフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-フェニル-1,1-ジ(2-メトキシフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ

-2-フェニル-1, 1-ジ(4-メトキシフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-フェニル-1, 1-ジベンジルエタノール、1-(R)-1-アミノ-1-フェニルメチル)シクロブタノール、1-(R)-1-アミノ-1-フェニルメチル)シクロペンタノール、1-(R)-1-アミノ-1-フェニルメチル)シクロヘキサノール、

## 【0016】

(R)-2-アミノ-2-(1-ナフチル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-(1-ナフチル)-1, 1-ジメチルエタノール、(R)-2-アミノ-2-(1-ナフチル)-1, 1-ジエチルエタノール、(R)-2-アミノ-(1-ナフチル)-1, 1-ジ-n-プロピルエタノール、(R)-2-アミノ-(1-ナフチル)-1, 1-ジフェニルエタノール、(R)-2-アミノ-2-(1-ナフチル)-1, 1-ジ(4-メチルフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-(1-ナフチル)-1, 1-ジ(2-メトキシフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-(1-ナフチル)-1, 1-ジ(4-メトキシフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-(1-ナフチル)-1, 1-ジベンジルエタノール、1-(R)-1-アミノ-1-(1-ナフチル)メチル)シクロブタノール、1-(R)-1-アミノ-1-(1-ナフチル)メチル)シクロペンタノール、1-(R)-1-アミノ-1-(1-ナフチル)メチル)シクロヘキサノール、

## 【0017】

(R)-2-アミノ-2-(2-ナフチル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-(2-ナフチル)-1, 1-ジメチルエタノール、(R)-2-アミノ-2-(2-ナフチル)-1, 1-ジエチルエタノール、(R)-2-アミノ-(2-ナフチル)-1, 1-ジ(n-プロピル)エタノール、(R)-2-アミノ-(2-ナフチル)-1, 1-ジフェニルエタノール、(R)-2-アミノ-2-(2-ナフチル)-1, 1-ジ(4-メチルフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-(2-ナフチル)-1, 1-ジ(2-メトキシフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-(2-ナフチル)-1, 1-ジ(4-メトキシフェニル)エタノール、(R)-2-アミノ-2-(2-ナフチル)-1, 1-ジベンジルエタノール、1-(R)-1-アミノ-1-(2-ナフチル)メチル)シクロブタノール、1-(R)-1-アミノ-1-(2-ナフチル)メチル)シクロペンタノール、1-(R)-1-アミノ-1-(2-ナフチル)メチル)シクロヘキサノール、

## 【0018】

(R)-2-アミノ-3-フェニルプロパノール、(R)-2-アミノ-3-フェニル-1, 1-ジメチルプロパノール、(R)-2-アミノ-3-フェニル-1, 1-ジエチルプロパノール、(R)-2-アミノ-3-フェニル-1, 1-ジ(n-プロピル)プロパノール、(R)-2-アミノ-3-フェニル-1, 1-ジフェニルプロパノール、(R)-2-アミノ-3-フェニル-1, 1-ジ(4-メチルフェニル)プロパノール、(R)-2-アミノ-3-フェニル-1, 1-ジ(2-メトキシフェニル)プロパノール、(R)-2-アミノ-3-フェニル-1, 1-ジ(4-メトキシフェニル)プロパノール、(R)-2-アミノ-3-フェニル-1, 1-ジベンジルプロパノール、1-(R)-1-アミノ-2-フェニルエチル)シクロブタノール、1-(R)-1-アミノ-2-フェニルエチル)シクロペンタノール、1-(R)-1-アミノ-2-フェニルエチル)シクロヘキサノール等、および上記各化合物における(R)が(S)に相当する化合物およびこれらの塩酸塩、硫酸塩、酢酸塩などの塩が挙げられる。

## 【0019】

また、上記光学活性なアミノアルコール(1)は、対応する光学活性なアミノ酸エステル、またはその塩酸塩、硫酸塩、酢酸塩などの塩と、対応するグリニャール試剤とを反応させることにより、容易に合成することができる。

## 【0020】

光学活性なアミノ酸エステルとしては(R)-アラニンメチルエステル、(R)-バリンメチルエステル、(R)-ロイシンメチルエステル、(R)-tert-ロイシンメチル

ルエステル、(R)－フェニルグリシンメチルエステル、(R)－(1－ナフチル)グリシンメチルエステル、(R)－(2－ナフチル)グリシンメチルエステル、(R)－フェニルアラニンメチルエステル、およびこれら化合物のエステル部分のメチル基が、エチル基、プロピル基、*n*－ブチル基等に置き換わった化合物、および上記各化合物における(R)が(S)に相当する化合物およびこれらの塩酸塩、硫酸塩、酢酸塩などの塩が挙げられる。

#### 【0021】

式(2)で示されるジエステル化合物(以下、ジエステル(2)と略記する。)において、 $R^3$  および  $R^4$  は同一または相異なって、それぞれ水素原子または炭素数1～3のアルキル基を表わす。 $R^5$  は炭素数1～3のアルキル基を表わし、*m*は0～2の整数を表す。

#### 【0022】

かかるジエステル(2)としては、例えばシュウ酸ジメチル、シュウ酸ジエチル、マロン酸ジメチル、マロン酸ジエチル、ジメチルマロン酸ジメチル、ジメチルマロン酸ジエチル、ジエチルマロン酸ジメチル、ジエチルマロン酸ジエチル、コハク酸ジメチル、コハク酸ジエチル等が挙げられる。

#### 【0023】

ジエステル(2)の使用量は、光学活性なアミノアルコール(1)に対して通常0.2～2モル倍、好ましくは0.4～1モル倍程度である。

#### 【0024】

光学活性なアミノアルコール(1)とジエステル(2)との反応において、通常、リチウム化合物が触媒として用いられる。

#### 【0025】

ここで用いられるリチウム化合物としては、例えば水酸化リチウム、例えばリチウムメトキシド、リチウムエトキシド等のリチウムアルコキシド、例えば塩化リチウム等のハロゲン化リチウム、などが挙げられる。その使用量は特に限定されないが、通常はジエステル(2)に対して0.0005～0.5モル倍程度である。

#### 【0026】

反応は通常、溶媒の存在下に実施される。用いられる溶媒としては、例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素溶媒、例えばヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素溶媒、例えばクロルベンゼン等のハロゲン化炭化水素溶媒、例えばテトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル溶媒などが挙げられる。これらはそれぞれ単独または二種以上を混合して用いられ、その使用量は特に限定されるものではないが、光学活性なアミノアルコール(1)に対して通常、2～500重量倍程度である。

#### 【0027】

反応温度は特に制限されず、通常20～150℃程度の範囲である。また、反応中に副生する式(4)

#### 【化4】



(式中、 $R^5$  は上記と同一の意味を表わす。)

で示されるアルコールの沸点以上の温度で、該アルコールを系外へ除去しながら反応を実施することが好ましい。

#### 【0028】

反応終了後、例えば反応混合物に水を加え、必要によりトルエン、酢酸エチルなどの水に不溶な有機溶媒を用いて抽出処理し、得られた有機層を濃縮することによって、式(3)で示される光学活性なビスアミドアルコール化合物(以下、光学活性なビスアミドアルコール(3)と略記する。)を得ることができる。または反応混合物から生成物が析出する場合、ろ過等の操作により目的物を取得することができる。得られた光学活性なビスアミドアルコール(3)はさらに通常の方法、たとえば、蒸留操作、再結晶などの方法で精



製することもできる。

【0029】

かくして得られる光学活性なビスアミドアルコール (3) において、\*で示される不斉中心の立体配置は、用いた光学活性なアミノアルコール (1) の立体配置と同様である。

【0030】

かかる光学活性なビスアミドアルコール (3) としては、例えば N, N' -ビス [(R) -1-メチル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1, 2-ジメチル-2-ヒドロキシプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-メチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-メチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-メチル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-メチル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-メチル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-メチル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-メチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-(1-ヒドロキシシクロブチル) エチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-(1-ヒドロキシシクロペンチル) エチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル) エチル] エタン-1, 2-ジアミド、

【0031】

N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソプロピル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -2-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル) プロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -2-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル) プロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -2-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル) プロピル] エタン-1, 2-ジアミド、

【0032】

N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエ

チル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-3-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル) ブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-3-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル) ブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-3-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル) ブチル] エタン-1, 2-ジアミド、

## 【0033】

N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-tert-ブチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2, 2-ジメチル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル) プロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2, 2-ジメチル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル) プロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2, 2-ジメチル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル) プロピル] エタン-1, 2-ジアミド、

## 【0034】

N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル) メチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル) メチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル) メチル] エタン-1, 2-ジアミド、

## 【0035】

N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス

ス [(R)-1-(1-ナフチル)-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル] エタン-1, 2-ジアミド、

## 【0036】

N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル] エタン-1, 2-ジアミド、

## 【0037】

N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル] エタン-1, 2-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル] エタン-

1, 2-ジアミド、

【0038】

N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1, 2-ジメチル-2-ヒドロキシプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル] プロパン-1, 3-ジアミド、

【0039】

N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソプロピル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)プロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)プロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)プロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、

【0040】

N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-イソブチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-3-

メチル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)ブチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-3-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)ブチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-3-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)ブチル]プロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0041】

N, N'-ビス[(R)-1-tert-ブチル-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-tert-ブチル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-tert-ブチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-tert-ブチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-tert-ブチル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-tert-ブチル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-tert-ブチル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-tert-ブチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-2, 2-ジメチル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)プロピル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-2, 2-ジメチル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)プロピル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-2, 2-ジメチル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)プロピル]プロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0042】

N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル]プロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0043】

N, N'-ビス[(R)-1-(1-ナフチル)-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-(1-ナフチル)-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-(1-ナフチル)-2-エチル-2-ヒドロキシブチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-(1-ナフチル)-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-(1-ナフチル)-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル]プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス[(R)-1-(1-ナフチル)-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ

エチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(1-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル] プロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0044】

N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-(2-ナフチル)-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル] プロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0045】

N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル] プロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0046】

N, N'-ビス [(R)-1-メチル-2-ヒドロキシエチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1, 2-ジメチル-2-ヒドロキシ

プロピル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-メチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-メチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-メチル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-メチル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル) - 2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-メチル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル) - 2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-メチル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル) - 2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-メチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1- (1-ヒドロキシシクロブチル) エチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1- (1-ヒドロキシシクロペンチル) エチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1- (1-ヒドロキシシクロヘキシル) エチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0047】

N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル) - 2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル) - 2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル) - 2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソプロピル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 2-メチル-1- (1-ヒドロキシシクロブチル) プロピル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 2-メチル-1- (1-ヒドロキシシクロペンチル) プロピル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 2-メチル-1- (1-ヒドロキシシクロヘキシル) プロピル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0048】

N, N' -ビス [(R) - 1-イソブチル-2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソブチル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソブチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソブチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソブチル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソブチル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル) - 2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) - 1-イソブチル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル) - 2-ヒドロキシエチル] - 2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、

ージアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2, 2-ジ (4-メトキシフェニル) -2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-イソブチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -3-メチル-1- (1-ヒドロキシシクロブチル) ブチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -3-メチル-1- (1-ヒドロキシシクロペンチル) ブチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -3-メチル-1- (1-ヒドロキシシクロヘキシル) ブチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0049】

N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2, 2-ジ (4-メチルフェニル) -2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2, 2-ジ (2-メトキシフェニル) -2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2, 2-ジ (4-メトキシフェニル) -2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-tert-ブチル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -2, 2-ジメチル-1- (1-ヒドロキシシクロブチル) プロピル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -2, 2-ジメチル-1- (1-ヒドロキシシクロペンチル) プロピル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -2, 2-ジメチル-1- (1-ヒドロキシシクロヘキシル) プロピル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、

## 【0050】

N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2-メチル-2-ヒドロキシプロピル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2-エチル-2-ヒドロキシブチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2, 2-ジ (4-メチルフェニル) -2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2, 2-ジ (2-メトキシフェニル) -2-ヒドロキシエチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2, 2-ジ (4-メトキシフェニル) -2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-1- (1-ヒドロキシシクロブチル) メチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-1- (1-ヒドロキシシクロペンチル) メチル] -2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N' -ビス [(R) -1-フェニル-1- (1-ヒ



【 0 0 5 1 】

【 0 0 5 2 】

【 0 0 5 3 】

出証特2004-3101388

パン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-n-プロピル-2-ヒドロキシペンチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジフェニル-2-ヒドロキシエチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2, 2-ジ(4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-1-ベンジル-2-ベンジル-2-ヒドロキシ-3-フェニルプロピル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド、N, N'-ビス [(R)-2-フェニル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル]-2, 2-ジメチルプロパン-1, 3-ジアミド等および前記各化合物の立体配置 (R) が、(S) に代わった化合物等が挙げられる。

#### 【実施例】

##### 【0054】

以下、実施例により本発明をさらに詳細に説明するが、本発明はこれら実施例に限定されるものでない。

##### 【0055】

#### 実施例 1

窒素置換した 100 mL シュレンク管中で (R)-フェニルグリシノール 980 mg (7.14 mmol)、マロン酸ジメチル 472 mg (3.57 mmol)、リチウムメトキシド 6.8 mg (0.18 mmol)、およびノルマルヘプタン 40 mL を混合し、100℃にて 3 時間撹拌した。反応が進行すると均一溶液から白色懸濁液となった。その後、室温まで冷却して反応液をろ過し、得られた粉末を乾燥すると N, N'-ビス [(R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミドの白色粉末が 1.15 g 得られた。

収率: 94%。(マロン酸ジメチル基準)

##### 【0056】

#### 実施例 2

実施例 1 において、反応試剤としてそれぞれ (S)-tert-ロイシノール 980 mg (8.36 mmol)、マロン酸ジメチル 552 mg (4.18 mmol)、リチウムメトキシド 7.9 mg (0.21 mmol) を用いた以外は、実施例 1 と同様に実施した。N, N'-ビス [(S)-1-tert-ブチル-2-ヒドロキシエチル] プロパン-1, 3-ジアミドの白色粉末が 1.20 g 得られた。

収率: 95%。(マロン酸ジメチル基準)

##### 【0057】

#### 実施例 3

実施例 1 において、反応試剤としてそれぞれ (S)-tert-ロイシノール 1.470 g (12.5 mmol)、シュウ酸ジメチル 741 mg (6.27 mmol)、リチウムメトキシド 11.9 mg (0.31 mmol) を用いた以外は、実施例 1 と同様に実施した。N, N'-ビス [(S)-1-tert-ブチル-2-ヒドロキシエチル] エタン-1, 2-ジアミドの白色粉末が 1.79 g 得られた。

収率: 99%。(シュウ酸ジメチル基準)

【書類名】 要約書

【要約】

【課題】

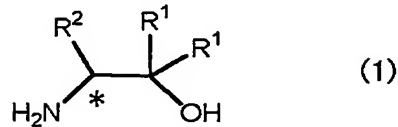
供すること。

【解決手段】

光学活性なビスアミドアルコール化合物の効率のよい製造方法を提

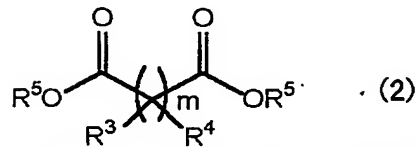
リチウム化合物の存在下、式 (1)

【化 1】



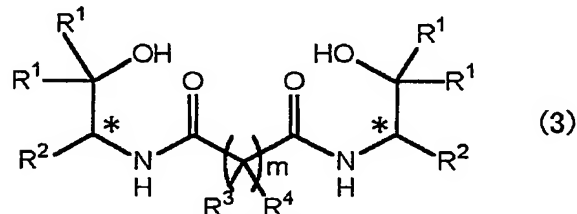
で示される光学活性なアミノアルコール化合物と、式 (2)

【化 2】



で示されるジエステル化合物とを反応させることによる式 (3)

【化 3】



で示される光学活性なビスアミドアルコール化合物の製造方法であり、本発明によれば、不斉合成触媒の配位子中間体等として有用な光学活性なビスアミドアルコール化合物を効率よく安価に製造することが可能となるため、工業的に有利である。

【選択図】

なし

特願 2 0 0 3 - 4 2 4 5 7 9

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [ 0 0 0 0 0 2 0 9 3 ]

1. 変更年月日 1 9 9 0 年 8 月 2 8 日  
[変更理由] 新規登録  
住 所 大阪府大阪市中央区北浜 4 丁目 5 番 3 3 号  
氏 名 住友化学工業株式会社
2. 変更年月日 2 0 0 4 年 1 0 月 1 日  
[変更理由] 名称変更  
住所変更  
住 所 東京都中央区新川二丁目 2 7 番 1 号  
氏 名 住友化学株式会社